

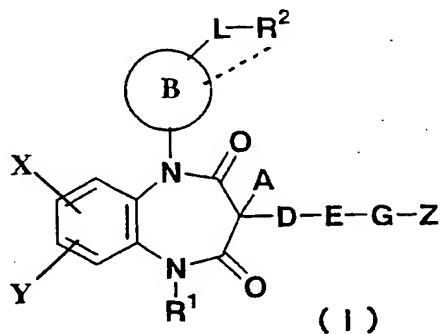
PCT

世界知的所有権機関  
国際事務局

## 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類7 C07D 243/12, A61K 31/551, C07D 401/04, 403/04, A61P 3/04, 3/10		A1	(11) 国際公開番号  (43) 国際公開日	WO00/23428  2000年4月27日(27.04.00)
(21) 国際出願番号  (22) 国際出願日  (30) 優先権データ 特願平10/298941	PCT/JP99/05754  1999年10月19日(19.10.99)  1998年10月20日(20.10.98) JP		(74) 代理人 弁理士 朝日奈忠夫, 外(ASAHINA, Tadao et al.) 〒532-0024 大阪府大阪市淀川区十三本町2丁目17番85号 武田薬品工業株式会社 大阪工場内 Osaka, (JP)	
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 武田薬品工業株式会社 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)(JP/JP) 〒541-0045 大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号 Osaka, (JP)			(81) 指定国 AE, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CR, CU, CZ, DM, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, US, UZ, VN, YU, ZA, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ニーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)	
(72) 発明者 : および (75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 大井 哲(OI, Satoru)[JP/JP] 〒631-0033 奈良県奈良市あやめ池南1丁目7番10-509号 Nara, (JP) 鈴木伸宏(SUZUKI, Nobuhiro)[JP/JP] 〒305-0861 茨城県つくば市大字谷田部1077番地の50 Ibaraki, (JP) 松本孝浩(MATSUMOTO, Takahiro)[JP/JP] 〒666-0245 兵庫県川辺郡猪名川町つつじが丘1丁目 2番4号 Hyogo, (JP)			添付公開書類 国際調査報告書	
<p>(54) Title: 1,5-BENZODIAZEPINE COMPOUNDS, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME, AND MEDICINE</p> <p>(54) 発明の名称 1,5-ベンゾジアゼピン化合物、その製法及び医薬</p> <p style="text-align: center;"> <span style="margin-left: 20px;">(I)</span> </p> <p>(57) Abstract Compounds represented by formula (I) or salts thereof: (I) wherein ring B represents an optionally substituted cyclic hydrocarbon group; Z represents hydrogen or an optionally substituted cyclic group; R¹ represents hydrogen, an optionally substituted hydrocarbon group, an optionally substituted heterocyclic group, or acyl; R² represents optionally substituted amino; D represents a bond or a divalent group; E represents a bond, -CO-, -CON(R³)-, -COO-, -N(R³)CON(R⁴)-, -N(R³)COO-, -N(R³)SO₂-, -N(R³)SO₃-, -O-, -S-, -SO-, or SO₂- (R³ and R⁴ each independently represents hydrogen or an optionally substituted hydrocarbon group); G represents a bond or a divalent group; L represents a bond or a divalent group; A represents hydrogen or a substituent; X and Y each represents hydrogen or an independent substituent; and ..... indicates that R² may be bonded to an atom on the ring B to form a ring.</p>				

式 (I)



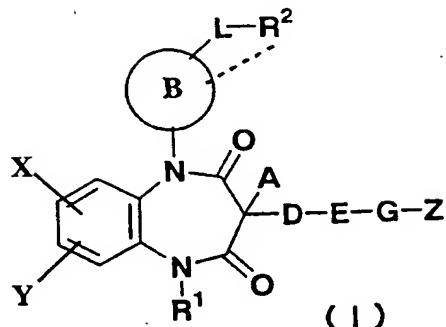
[式中、B環は置換基を有していてもよい環状炭化水素基を；Zは水素原子または置換基を有していてもよい環状基を；R<sup>1</sup>は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよい複素環基またはアシル基を；R<sup>2</sup>は置換されていてもよいアミノ基を；Dは結合手または2価の基を；Eは結合手、-CO-、-CON(R<sup>a</sup>)-、-COO-、-N(R<sup>b</sup>)CON(R<sup>b</sup>)-、-N(R<sup>a</sup>)COO-、-N(R<sup>a</sup>)SO<sub>2</sub>-、-N(R<sup>a</sup>)-、-O-、-S-、-SO-または-SO<sub>2</sub>(R<sup>a</sup>)、R<sup>b</sup>は独立して水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示す)を；Gは結合手または2価の基を；Lは結合手または2価の基を；Aは水素原子または置換基を；XおよびYは水素原子または独立した置換基をそれぞれ示し、……はR<sup>2</sup>とB環上の原子とで環を形成していてもよいことを示す。]で表される化合物またはその塩、およびその製造法。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE アラブ首長国連邦	DM ドミニカ	KZ カザフスタン	RU ロシア
AL アルバニア	EE エストニア	LC セントルシア	SD スーダン
AM アルメニア	ES スペイン	LI リヒテンシュタイン	SE スウェーデン
AT オーストリア	FI フィンランド	LK リビ・ランカ	SG シンガポール
AU オーストラリア	FR フランス	LR リベリア	SI スロヴェニア
AZ アゼルバイジャン	GA ガボン	LS レソト	SK スロヴァキア
BA ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB 英国	LT リトアニア	SL シエラ・レオネ
BB バルバドス	GDE グレナダ	LU ルクセンブルグ	SN セネガル
BE ベルギー	GE グルジア	LV ラトヴィア	SZ スワジ蘭
BF ブルギア・ファン	GH ガーナ	MA モロッコ	TD チャード
BG ブルガリア	GM ガンビア	MC モナコ	TG トーゴ
BJ ベナン	GN ギニア	MD モルドヴァ	TJ タジキスタン
BR ブラジル	GW ギニア・ビサオ	MG マダガスカル	TZ タンザニア
BY ベラルーシ	GR ギリシャ	MK マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TM トルクメニスタン
CA カナダ	HR クロアチア	共和国	TR トルコ
CF 中央アフリカ	HU ハンガリー	ML マリ	TT トリニダッド・トバゴ
CG コンゴー	IDE インドネシア	MN モンゴル	UA ウクライナ
CH スイス	IE アイルランド	MR モーリタニア	UG ウガンダ
CI コートジボアール	IL インド	MW マラウイ	US 米国
CM カメルーン	IS アイスランド	MX メキシコ	UZ ウズベキスタン
CN 中国	IT イタリア	NE ニジェール	VN ヴィエトナム
CR コスタ・リカ	JP 日本	NL オランダ	YU ユーゴースラビア
CU キューバ	KE ケニア	NO ノールウェー	ZA 南アフリカ共和国
CY キプロス	KG キルギスタン	NZ ニュー・ジーランド	ZW ジンバブエ
CZ チェコ	KP 北朝鮮	PL ポーランド	
DE ドイツ	KR 韓国	PT ポルトガル	
DK デンマーク		RO ルーマニア	

## 請求の範囲

## 1. 式 (I)



[式中、B環は置換基を有していてもよい環状炭化水素基を；Zは水素原子または置換基を有していてもよい環状基を；R<sup>1</sup>は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよい複素環基またはアシル基を；R<sup>2</sup>は置換されていてもよいアミノ基を；Dは結合手または2価の基を；Eは結合手、-CO-、-CON(R<sup>a</sup>)-、-COO-、-N(R<sup>a</sup>)CON(R<sup>b</sup>)-、-N(R<sup>a</sup>)COO-、-N(R<sup>a</sup>)SO<sub>2</sub>-、-N(R<sup>a</sup>)-、-O-、-S-、-SO-または-SO<sub>2</sub>-(R<sup>a</sup>)、R<sup>b</sup>は独立して水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示す]で表される化合物またはその塩。

10 2. Eが-CO-、-CON(R<sup>a</sup>)-、-COO-、-N(R<sup>a</sup>)CON(R<sup>b</sup>)-、-N(R<sup>a</sup>)COO-、-N(R<sup>a</sup>)SO<sub>2</sub>-、-N(R<sup>a</sup>)-、-O-、-S-、-SO-または-SO<sub>2</sub>-(R<sup>a</sup>)、R<sup>b</sup>は独立して水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示す)である請求項1記載の化合物。

15 3. Lが(1)結合手または

20 (2) i) C<sub>1-6</sub>アルキル基、

25 ii) ハロゲノ-C<sub>1-6</sub>アルキル基、

iii) フェニル基、

iv) ベンジル基、

v) 置換基を有していてもよいアミノ基、

vi) 置換基を有していてもよいヒドロキシ基、および

vii) ①C<sub>1-6</sub>アルキル基、

②置換基を有していてもよいフェニル基または

③置換基を有していてもよい複素環基で

それぞれ置換されていてもよいカルバモイル基またはチオカルバモイル基から選ばれた置換基1～5個を有していてもよく、-O-または-S-を介していてもよい2価の炭化水素基である請求項1記載の化合物。

4. Zは置換基を有していてもよい環状基である請求項1記載の化合物。

5. Dが炭素原子を介して環に結合する2価の基である請求項1記載の化合物。

6. B環が置換基を有していてもよいベンゼン環かつしがC<sub>1-6</sub>アルキレン基である請求項1記載の化合物。

7. Gが置換基を有していてもよい2価の炭化水素基を示し、かつB環がR<sup>2</sup>と環を形成しない請求項1記載の化合物。

8. Aが水素原子、B環がベンゼン環、Zがハロゲンで置換されたフェニル基およびR'が(1)ヒドロキシ、(2)フェニル、(3)C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルまたはC<sub>6-14</sub>アリールカルボニル、および(4)C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルまたはC<sub>6-14</sub>アリールスルホニルで置換されていてもよいアミノ基から選ばれた置換基でそれぞれ置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルまたはC<sub>7-14</sub>アラルキル基である請求項1記載の化合物。

9. X、Yが独立して水素原子、ハロゲン、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、ハロゲノ-C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>7-14</sub>アラルキルオキシ、ベンゾイル-C<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヒドロキシ-C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル-C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-14</sub>シクロアルキル-C<sub>1-6</sub>アルコキシ、イミダゾール-1-イル-C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>7-14</sub>アラルキルオキシカルボニル-C<sub>1-6</sub>アルコキシまたはヒドロキシフェニル-C<sub>1-6</sub>アルコキシ；

20 B環がC<sub>1-6</sub>アルコキシで置換されていてもよいベンゼン環、またはR<sup>2</sup>と結合して形成されたテトラヒドロイソキノリン環またはイソインドリン環；

Zがハロゲン、ホルミル、ハロゲノ-C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル、オキソおよびピロリジニルから選ばれる1ないし3個の置

換基をそれぞれ有していてもよいC<sub>6-14</sub>アリール基、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル基、ピペリジル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、チアゾリル基、インダニル基またはインドリル基；

Aが水素原子；

5 DがC<sub>1-6</sub>アルキレン基；

Gが結合手、またはフェニレンを含有していてもよく、かつフェニルで置換され  
ていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキレン基；

R'が水素原子、(1)ハロゲン、(2)ニトロ、(3)C<sub>1-6</sub>アルキルーカルボニルで置  
換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル、ベンゾイルオキシカルボニルおよびC<sub>1-6</sub>アル  
キルスルホニルから選ばれる1または2個の置換基を有していてもよいアミノ、

10 (4)(i)ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルーカルボニル、カルボキシまたはC<sub>1-6</sub>アルコキ  
シーカルボニルで置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル、(ii)ヒドロキシで置換さ  
れていてもよいフェニル、(iii)ベンゾイルまたは(iv)モノーまたはジ-C<sub>1-6</sub>アル

15 キルアミノーカルボニルで置換されていてもよいヒドロキシ、(5)C<sub>3-6</sub>シクロアル  
キル、(6)ヒドロキシまたはハロゲノ-C<sub>1-6</sub>アルキルで置換されていてもよいフェ  
ニルおよび(7)チエニル、フリル、チアゾリル、インドリルまたはベンジルオキシ

20 カルボニルピペリジルから選ばれた置換基でそれぞれ置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>  
アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>6-14</sub>アリール基またはC<sub>7-14</sub>アラルキル基；

R<sup>2</sup>が(1)無置換のアミノ基、(2)ピペリジル基または(3)(i)ベンジル、(ii)アミノ  
またはフェニルで置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル、(iii)モノーまたはジ-C<sub>1-6</sub>

25 <sub>1-6</sub>アルキルーカルバモイル、またはモノーまたはジ-C<sub>1-6</sub>アルキルーチオカルバ  
モイル、(iv)C<sub>1-6</sub>アルコキシーカルボニル、(v)C<sub>1-6</sub>アルキルースルホニル、(vi)

ピペリジルカルボニルおよび(vii)ハロゲンまたはアミノで置換されていてもよ  
いC<sub>1-6</sub>アルキルーカルボニルから選ばれる1または2個の置換基を有していてもよ

いアミノ；

Eが結合手、-CON(R<sup>a</sup>)-、-N(R<sup>a</sup>)CO-、-N(R<sup>a</sup>)CON(R<sup>b</sup>)-(R<sup>a</sup>  
およびR<sup>b</sup>がそれぞれ水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基)；

Lが-O-を介していてもよく、かつC<sub>1-6</sub>アルキルで置換されていてもよいC<sub>1</sub>

$-_6$  アルキレン基である請求項 1 記載の化合物。

10. X, Y が独立して水素原子、ハロゲン、ヒドロキシまたは  $C_{1-6}$  アルコキシ

B 環がベンゼン環、R<sup>2</sup> と結合してテトラヒドロイソキノリン環またはイソイン

5 ドリン環；

Z がハロゲンで置換されていてもよいフェニル基、D が  $C_{1-6}$  アルキレン基、G が  $C_{1-6}$  アルキレン基；

R<sup>1</sup> が(1)ヒドロキシ、(2)フェニルおよび(3)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルまたは  $C_{1-6}$  アルキルスルホニルで置換されていてもよいアミノから選ばれた置換基でそれ

10. ぞれ置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基または  $C_{7-14}$  アラルキル基；

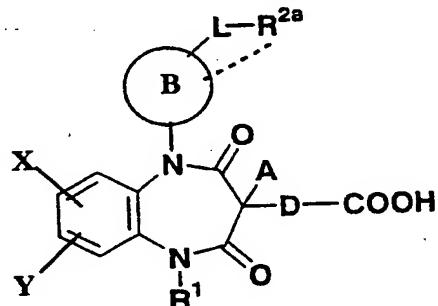
R<sup>2</sup> が無置換のアミノ基；

E が  $-CONH-$ ；

L が  $C_{1-6}$  アルキレン基である請求項 1 記載の化合物。

11. 請求項 1 記載の化合物またはその塩のプロドラッグ。

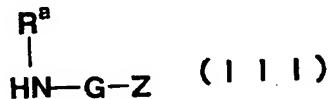
15. 12. 式 (IIIa)



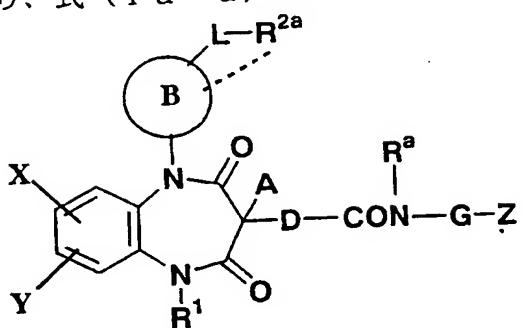
(IIIa)

[式中、R<sup>2a</sup> は保護されていてもよく、置換されていてもよいアミノ基、その他の記号は請求項 1 記載と同意義を示す。] で表される化合物、その反応性誘導体またはその塩と式

20



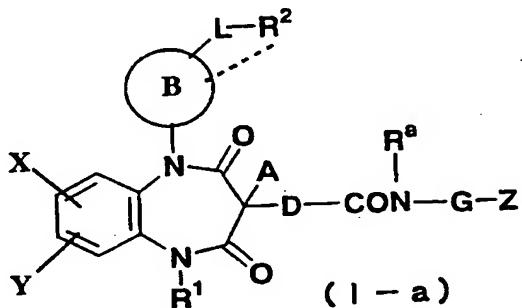
[式中の記号は請求項1記載と同意義を示す。] で表される化合物またはその塩と  
を反応させることにより、式(I-a-a)



(I-a-a)

[式中の記号は前記と同意義を示す。] で表される化合物またはその塩を製造し、

5 所望により、脱保護反応に付することを特徴とする式(I-a)



10

[式中の記号は前記と同意義を示す。] 化合物またはその塩の製造法。

13. 請求項1記載の化合物またはその塩を含有することを特徴とする医薬組成物

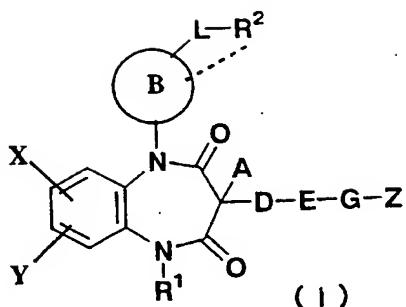
15 14. ソマトスタチン受容体機能調節剤である請求項13記載の医薬組成物。

15. ソマトスタチン受容体機能調節剤がソマトスタチン受容体作動薬である請求

項14記載の医薬組成物。

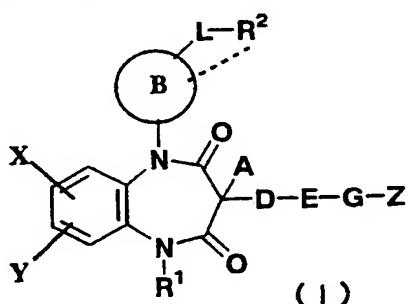
16. 糖尿病、肥満、糖尿病合併症または難治性下痢の予防または治療剤である請  
求項13記載の医薬組成物。

20 17. 式(I)



[式中、B環は置換基を有していてもよい環状炭化水素基を；Zは水素原子または置換基を有していてもよい環状基を；R<sup>1</sup>は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよい複素環基またはアシリル基を；R<sup>2</sup>は置換され  
10 ていてもよいアミノ基を；Dは結合手または2価の基を；Eは結合手、-CO-, -CON(R<sup>a</sup>)-, -COO-, -N(R<sup>a</sup>)CON(R<sup>b</sup>)-, -N(R<sup>a</sup>)COO-, -N(R<sup>a</sup>)SO<sub>2</sub>-,-N(R<sup>a</sup>)-, -O-, -S-, -  
SO-または-SO<sub>2</sub>-(R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>は独立して水素原子または置換基を有していてもよい炭  
化水素基を示す)を；Gは結合手または2価の基を；Lは結合手または2価の基を  
15 ；Aは水素原子または置換基を；XおよびYは水素原子または独立した置換基をそ  
れぞれ示し、……はR<sup>2</sup>とB環上の原子とで環を形成していてもよいことを示す  
.]で表される化合物またはその塩を投与することを特徴とするソマトスタチン受  
容体機能を調節する方法。

18. ソマトスタチン受容体機能調節のための医薬を製造するための、式 (I)



25 [式中、B環は置換基を有していてもよい環状炭化水素基を；Zは水素原子または置  
換基を有していてもよい環状基を；R<sup>1</sup>は水素原子、置換基を有していてもよい炭化  
水素基、置換基を有していてもよい複素環基またはアシリル基を；R<sup>2</sup>は置換され  
いてもよいアミノ基を；Dは結合手または2価の基を；Eは結合手、-CO-, -CON(R<sup>a</sup>  
-)

)-, -COO-, -N(R<sup>a</sup>)CON(R<sup>b</sup>)-, -N(R<sup>a</sup>)COO-, -N(R<sup>a</sup>)SO<sub>2</sub>-,-N(R<sup>a</sup>)-, -O-, -S-, -SO-または-  
SO<sub>2</sub>- (R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>は独立して水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示す)を；Gは結合手または2価の基を；Lは結合手または2価の基を；Aは水素原子または置換基を；XおよびYは水素原子または独立した置換基をそれぞれ示し、  
.....はR<sup>2</sup>とB環上の原子とで環を形成していてもよいことを示す。]で表される  
化合物またはその塩の使用。

## SEQUENCE LISTING

<110> Takeda Chemical Industries, Ltd.

<120> Fused Ring Compounds, their Production Method and Agents

<130> 2560W00P

<150> JP 10-298941

<151> 1998-10-20

<160> 10

<210> 1

<211> 30

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223>

<400> 1

GGTCGACCTC AGCTAGGATG TTCCCCAATG

30

<210> 2

<211> 28

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223>

<400> 2

GGTCGACCCG GGCTCAGAGC GTCGTGAT

28

<210> 3

<211> 28

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

&lt;223&gt;

&lt;400&gt; 3

GGTCGACACC ATGGACATGG CGGATGAG

28

&lt;210&gt; 4

&lt;211&gt; 26

&lt;212&gt; DNA

&lt;213&gt; Artificial Sequence

&lt;220&gt;

&lt;223&gt;

&lt;400&gt; 4

GGTCGACAGT TCAGATACTG GTTTGG

26

&lt;210&gt; 5

&lt;211&gt; 30

&lt;212&gt; DNA

&lt;213&gt; Artificial Sequence

&lt;220&gt;

&lt;223&gt;

&lt;400&gt; 5

GGTCGACCTC AACCATGGAC ATGCTTCATC

30

&lt;210&gt; 6

&lt;211&gt; 29

&lt;212&gt; DNA

&lt;213&gt; Artificial Sequence

&lt;220&gt;

&lt;223&gt;

&lt;400&gt; 6

GGTCGACTTT CCCCCAGGCCCTACAGGTAA

29

&lt;210&gt; 7

&lt;211&gt; 28

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223>

<400> 7

GGCTCGAGTC ACCATGAGCG CCCCTCG

28

<210> 8

<211> 27

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223>

<400> 8

GGGCTCGAGC TCCTCAGAAG GTGGTGG

27

<210> 9

<211> 28

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223>

<400> 9

GGTCGACCAAC CATGGAGCCC CTGTTCCC

28

<210> 10

<211> 26

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223>

<400> 10

WO 00/23428

4/4

/JP99/05754

CCGTCGACAC TCTCACAGCT TGCTGG

26

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/05754

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
 Int.Cl<sup>7</sup> C07D243/12 A61K31/551 C07D401/04, C07D403/04  
 A61P 3/04, A61P3/10

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
 Int.Cl<sup>7</sup> C07D243/12 A61K31/551 C07D401/04, C07D403/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
 CAPLUS, REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	CHRISTOS, P. et al. "A Non-peptide ligand for the somato-statin receptor having a benzodiazepinone structure", Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, vol. 6 (No.3), pages 267-272 (1996), 06 February, 1996 (06.02.96) the whole document	1-18
A	P.SHAH J. R. et al. "Novel 1,5-benzodiazepidinone Gastrin/CCKB Antagonists", Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, vol. 7 (No.3), pages 281-286 (1997), 04 February, 1997 (04.02.97) the whole document	1-18
A	BRAD R. HENKE et al. "Optimization of the 3-(1H-Indazol-3-ylmethyl)-1,5-benzodiazepines as Potent, Orally Active CCK-A Agonists", Journal of Medicinal Chemistry, vol. 40 (No.17), pages 2706-2725 (1997)	1-18
A	WO, 96/11691, A1 (GLAXO WELCOME Inc. USA), 25 April, 1996 (25.04.96) & EP, 785787, A1 & US, 5910495, A & JP, 10-511931, A	1-18

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A"	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E"	earlier document but published on or after the international filing date
"L"	document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O"	document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P"	document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T"	later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&"	document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
31 January, 2000 (31.01.00)Date of mailing of the international search report  
08 February, 2000 (08.02.00)Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP99/05754

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: 17  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
The subject matter of claim 17 relates to a method for treatment of the human body by therapy or operation, which does not require an international search report by this International Search Authority in accordance with Rule 39.1(iv).
2.  Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest     The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
                         No protest accompanied the payment of additional search fees.

## A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. Cl' C07D 243/12 A61K 31/551 C07D 401/04, C07D 403/04  
A61P 3/04, A61P 3/10

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. Cl' C07D 243/12 A61K 31/551 C07D 401/04, C07D 403/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

## 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS, REGISTRY (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	CHRISTOS, P. et.al. "A Non-peptide ligand for the somato-statin receptor having a benzodiazepinone structure" Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, vol. 6 (No. 3) p267-272 (1996) 6.2月. 1996 (06.02.96) 全文献参照	1-18
A	P. SHAH J. R. et.al "Novel 1,5-benzodiazepidinone Gastrin/CCK <sub>a</sub> Antagonists" Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, vol. 7 (No. 3) p281-286 (1997) 4.2月. 1997 (04.02.97) 全文献参照	1-18

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献  
 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  
 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  
 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  
 「&」同一パテントファミリー文献

## 国際調査を完了した日

31.01.00

## 国際調査報告の発送日

08.02.00

## 国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)  
郵便番号 100-8915  
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

## 特許庁審査官(権限のある職員)

横尾 俊一

4P 7822

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**